

# 专 利 合 作 条 约

## PCT

专利性国际初步报告

(PCT 第II章)

(PCT 36 和细则 70)

REC'D 03 APR 2006

WIPO


PCT

申请人或代理人的档案号 031211CP	关于后续行为 参见 PCT/IPEA/416 表	
国际申请号 PCT/CN03/01115	国际申请日(日/月/年) 25. 12 月 2003 (25.12 03)	优先权日(日/月/年) 12. 12 月 2003 (12.12.03)
国际专利分类(IPC)或者国家分类和 IPC 两种分类 参见补充栏		
申请人 中国科学院上海药物研究所 等		

1. 本报告是国际初步审查单位根据条约 35 做出的国际初步审查报告，并依照条约 36 将其传送给申请人。
2. 本报告共计 8 页，包括扉页。
3. ☐ 本报告还有附件，
  - a. ☐ (传送给国际局和申请人)共计 \_\_\_\_\_ 页，包含  
☐ 修改后的并且作为本报告基础的说明书修改页、权利要求书修改页和/或附图修改页，和/或对  
 本国际初步审查单位所做出的更正页(见 PCT 细则 70.16 和行政规程 607)。  
☐ 国际初步审查单位认为修改超出原始公开范围的取代页，参见第 I 栏第 4 项和补充栏。
  - b. ☐ (传送给国际局) 共计 (指明电子载体的类型和数量) \_\_\_\_\_，包含有在与序列表有关的补充栏中  
 指明的电子形式的序列表和/或与其相关的表格。(行政规程 802)

4. 本报告包括关于下列各项的内容：

- I ☒ 报告的基础
- II ☐ 优先权
- III ☒ 不做出关于新颖性、创造性和工业实用性的意见
- IV ☐ 缺乏发明的单一性
- V ☒ 按条约 35(2)关于新颖性、创造性或工业实用性的理由；支持这种意见的引证和解释
- VI ☐ 引用的某些文件
- VII ☐ 国际申请中的某些缺陷
- VIII ☒ 对国际申请的某些意见

提交要求书的日期 11. 7 月 2005 (11.07.2005)	完成本报告的日期 06. 3 月 2006 (06.03.2006)
中华人民共和国国家知识产权局 IPEA/CN 中国北京市海淀区西土城路 6 号(100088)  传真号：(86-10)62019451	受权官员  电话号码：(86-10)62085562

I. 报告的基础

1. 关于语言, 本报告将基于:

- ☒ 申请提出时使用的语言。
- ☐ 该申请的\_\_\_\_\_语言译文, 提供该种语言的译文是
- ☐ 为了国际检索而提交的译文所使用的语言(细则 12.3 和 23.1(b))。
- ☐ 为了国际申请的公布而提交的译文所使用的语言(细则 12.4)。
- ☐ 为了国际初步审查而提交的译文所使用的语言(细则55.2和/或55.3)。

2. 关于国际申请中各个部分, 本报告基于(申请人为答复受理局根据条约 14 所发通知而提交的替换页, 在本报告中视为“原始提交”的文件, 不作为本报告的附件)

- ☒ 原始提交的国际申请。
- ☐ 说明书, 第\_\_\_\_\_页 原始提交的, \_\_\_\_\_ 初审单位收到的, \_\_\_\_\_ 初审单位收到的。
- ☐ 权利要求, 第\_\_\_\_\_页, 原始提交的, \_\_\_\_\_ 初审单位收到的, \_\_\_\_\_ 初审单位收到的。
- ☐ 附图, 第\_\_\_\_\_页, 原始提交的, \_\_\_\_\_ 初审单位收到的, \_\_\_\_\_ 初审单位收到的。
- ☐ 序列列表和/或相关表格——参见与序列列表有关的补充栏。

3. 修改导致以下内容的删除:

- ☐ 说明书, 第\_\_\_\_\_页
- ☐ 权利要求, 第\_\_\_\_\_项
- ☐ 附图, 第\_\_\_\_\_页, 图\_\_\_\_\_
- ☐ 序列列表(具体说明) \_\_\_\_\_
- ☐ 与序列列表相关的表格(具体说明) \_\_\_\_\_

4. ☐ 由于本报告附件的(某些)修改, 如下所列, 被认为超出了原始公开的范围, 如补充栏所示, 因此本报告是按照没有修改的情况做出的(细则 70.2(c))。

- ☐ 说明书, 第\_\_\_\_\_页
- ☐ 权利要求, 第\_\_\_\_\_项
- ☐ 附图, 第\_\_\_\_\_页, 图\_\_\_\_\_
- ☐ 序列列表(具体说明) \_\_\_\_\_
- ☐ 与序列列表相关的表格(具体说明) \_\_\_\_\_

\*如果第 4 项适用, 一些或全部的文件页可能做出“被取代”标记。

专利性国际初步报告

国际申请号

PCT/CN03/01115

III. 对于新颖性、创造性和工业实用性不做出审查意见

1. 对于:

☐ 整个国际申请

☒ 权利要求 9

没有审查所要求保护的发明是否具有新颖性, 创造性(非显而易见性), 或者工业实用性,  
因为:

☒ 该国际申请, 或所述权利要求 9

涉及下列无须进行国际初步审查的主题(具体说明):

权利要求 9 涉及对人体的治疗的治疗方法。

☐ 说明书、权利要求或者附图(下面特别指明的部分)或者所述权利要求  
不清楚, 以致不能形成任何有意义的审查意见(具体说明):

☐ 权利要求书或所述权利要求 没有得到说明书的充分支持,  
以致不能形成任何有意义的审查意见。(具体说明):

☐ 对权利要求 没有做出任何国际检索报告。

☐ 没有序列列表, 无法进行有意义的初步审查; 申请人在规定的期限内:

☐ 没有提交符合《行政规程》附录 C 规定标准的纸件形式的序列列表, 并且国际初步审查单位也未获得形式和方式可以接受的序列列表。

☐ 没有提交符合《行政规程》附录 C 规定标准的电子形式的序列列表, 并且国际初步审查单位也未获得形式和方式可以接受的序列列表。

☐ 在答复根据细则 13 条之三.1 (a) 或(b)和 13 条之二的通知提交序列列表时, 没有缴纳所要求的后提交费用。

☐ 没有与序列列表相关的表格, 无法做出有意义的书面意见; 申请人在规定的期限内没有提交符合行政规程附录 C 之二规定的技术要求的电子形式的表格, 并且国际初步审查单位也未获得形式和方式可以接受的这种表格。

☐ 与核苷酸和/或氨基酸序列列表相关的表格, 如果仅以电子形式提交, 不符合行政规程附录 C 之二的技术要求。

☐ 详情见补充栏。

专利性国际初步报告

国际申请号

PCT/CN03/01115

V. 按条约 35 (2) 关于新颖性、创造性或工业实用性的意见；支持这种理由的引证和解释

1. 意见

新颖性(N)	权利要求 <u>1-4 (部分), 5, 6-7 (部分), 8</u>	是
	权利要求 <u>1-4 (部分), 6-7 (部分)</u>	否
创造性(IS)	权利要求 <u>1-8 (部分)</u>	是
	权利要求 <u>1-8 (部分)</u>	否
工业实用性(IA)	权利要求 <u>1-8</u>	是
	权利要求 _____	否

2. 引证和解释 (细则 70.7)

参见补充栏

VIII. 对国际申请的某些评论意见

就权利要求、说明书和附图的清楚性，或者权利要求是否得到说明书的充分支持提出以下意见：

权利要求 1-3 要求保护的通式化合物中对基团  $Ar_1$  和  $Ar_2$  的定义过宽，包括了许多种类的化合物，而实际得到说明书支持的化合物（例如  $Ar_1$  为噻吩甲酰氧基取代的苯基的通式化合物）仅占权利要求 1-3 所要求保护化合物的极小部分。因此权利要求 1-3 得不到说明书的支持，不符合 PCT 条约第 6 条的规定。

补充栏

当前面的任何一栏地方不够时使用

续栏：第 V 栏第 2 节引证与解释

2.1 引用如下对比文件：

对比文件 1：JP3-50532A

对比文件 2：JP9-244229A

对比文件 3：JP11-273865A

对比文件 4：Shafi, P. M.等, “A new synthetic route to 4-arylidene-2-phenyl-2-imidazolin-5-ones”, Indian J. Chem., Sect. B:Org. Chem. Incl. Med. Chem., 1999, 38B(3), 378-379 页

对比文件 5：Agarwal, Rajesh 等, “Synthesis of 2-aryl-1-(4-morpholinophenyl)-4-(3,4-disubstituted-benzylidene)imidazolin-5-ones as CNS active agents”, Indian J. Chem., Sect. B, 1983, 22B(3), 308-310 页

对比文件 6：Follenius-Wund, Anny 等, “Fluorescent derivatives of the GFP chromophore give a new insight into the GFP fluorescence process”, Biophysical Journal, 2003, 85(3), 1839-1850 页

对比文件 7：WO03050098A

对比文件 8：美国化学文摘, CAN: 134:115892, “Synthesis of 1,2,4-trisubstituted 2-imidazolin-5-ones”, CAS RN: 52900-70-6

对比文件 9：美国化学文摘, CAN: 132:265133, “A convenient synthesis of 4-arylidene-2-phenyl-5-oxazolones catalyzed by KF-Alumina.”, CAS RN: 14326-80-8

2.2 新颖性评价

对比文件1公开了一系列通式（1）化合物，其中说明书第3页表1中公开的具体化合物1-3、6-8已经落入了权利要求1的范围内，因而权利要求1不具备新颖性，不符合PCT条约33(2)的规定。同样的，对比文件2说明书第8-9页公开的化合物（17）、（18）、（22）；对比文件3说明书第5页表1和对比文件4表1中所公开的化合物均破坏了权利要求1的新颖性。对比文件5公开了一种通式（III）化合物，该化合物落入了权利要求1-3的范围内，并且公开了权利要求4、6-7的制备方法，因此权利要求1-4和6-7不具备新颖性。

此外，对比文件6表1中公开的衍生物I-3、I-11、I-15、I-17、I-19、I-20、I-21和对比文件8公开的具体化合物（CA登记号：52900-70-6）和对比文件9公开的具体化合物（CA登记号：14326-80-8）也破坏了权利要求1-2的新颖性。

由于权利要求5和8要求保护的制备方法与对比文件1-9所公开的内容不同，因此权利要求5和8具备新颖性。

2.3 创造性

由于权利要求1-4（部分）和6-7（部分）不具备新颖性，故而权利要求1-4（部分）和6-7（部分）不具有创造性，不符合PCT条约33(3)的规定。

补充栏

当前面的任何一栏地方不够时使用

续 栏: 第 V 栏第 2 节引证与解释

对比文件 5 是权利要求 5 (部分)、权利要求 8 (部分) 最接近的现有技术。考虑到对比文件 5 的教导和本领域的公知常识, 本领域技术人员可以容易地得出权利要求 5 和 8 (部分) 的方案。因此, 权利要求 5 和 8 (部分) 是显而易见的, 不具备创造性, 不符合 PCT 条约 33(3) 的规定。

对比文件 1-6 和 8-9 仅公开了部分权利要求 1 所要求保护的通式化合物, 并且均未公开上述化合物具有治疗糖尿病等疾病的活性, 对比文件 7 虽然公开了一系列可用于治疗 II 型糖尿病的化合物, 但该化合物的杂环与权利要求 1 通式化合物的杂环结构不同。因此从权利要求 1 中排除上述对比文件所公开的化合物之后, 权利要求 1 (部分) 相对于对比文件 1-9 是非显而易见的, 权利要求 1 (部分) 具备创造性, 符合 PCT 条约 33(3) 的规定。同样地, 权利要求 2-8 (部分) 具备创造性, 符合 PCT 条约 33(3) 的规定。

#### 2.4 工业实用性评价:

权利要求 1-8 具备工业实用性, 符合 PCT 条约 33(4) 的规定。

补充栏

当前面的任何一栏地方不够时使用

续 栏: 国际专利分类(IPC)或者国家分类和 IPC 两种分类

C07D263/42 (2006.01) i

C07D263/46 (2006.01) i

C07D277/34 (2006.01) i

C07D277/36 (2006.01) i

C07D233/70 (2006.01) i

C07D233/84 (2006.01) i

A61K31/4164 (2006.01) i

A61K31/421 (2006.01) i

A61K31/426 (2006.01) i